

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

REC'D 19 JAN 2006

WIPO

PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054954/NI	WEITERES VORGEHEN		siehe Formblatt PCT/IPEA/416
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/011184	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 07.10.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 09.10.2003	
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A01N43/90			
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al			

1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 8 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen
a. <input type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um
<input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).
<input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.
b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) Insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).
4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:
<input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids <input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität <input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erforderliche Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit <input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung <input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erforderlichen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung <input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen <input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung <input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur Internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 12.07.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 20.01.2006
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Muellners, W Tel. +31 70 340-3289



Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
 - internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt*):

Beschreibung, Seiten

1-12 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10 in der ursprünglich eingereichten Fassung

- einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
 - Beschreibung: Seite
 - Ansprüche: Nr.
 - Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigefügten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c).
 - Beschreibung: Seite
 - Ansprüche: Nr.
 - Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/011184

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
Neuheit (N) Ja: Ansprüche 1-10
Nein: Ansprüche
- Erfinderische Tätigkeit (IS) Ja: Ansprüche
Nein: Ansprüche 1-10
- Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) Ja: Ansprüche: 1-10
Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V.

Es wird auf die folgenden im internationalen Recherchenbericht zitierten Entgegenhaltungen (D1-D7) verwiesen:

- D1: EP-A-0 988 790
- D2: WO 98/46607 A
- D3: US-A-4 331 670
- D4: US-A-5 593 996
- D5: US-B1-6 268 371
- D6: AKAGI TOSHIO ET AL: "Quantitative structure-activity relationships of fluazinam and related fungicidal N-phenylpyridinamines: Preventive activity against Sphaerotheca fuliginea, Pyricularia oryzae and Rhizoctonia solani" JOURNAL OF PESTICIDE SCIENCE, Bd. 21, Nr. 1, 1996, Seiten 23-29, XP008043156 ISSN: 0385-1559
- D7: US-A-6 100 261

Neuheit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist neu (Artikel 33(1) und (2) PCT).

Gegenstand des unabhängigen Anspruches 1 sind fungizide Mischungen zur Bekämpfung von Reispathogenen enthaltend Fluazinam einen Wirkstoff aus der Klasse der N-Pyridylaniline und ein spezifisches fungizides Triazolopyrimidin (im folgenden TP1 genannt) in einer synergistisch wirksamen Menge. Die übrigen unabhängigen Ansprüche 4, 9 und 10 richten sich auf ein Verfahren zur Bekämpfung von reispathogenen Schadpilzen mittels einer solchen Mischung, auf aus einem solchen Verfahren resultierendes Saatgut, das eine solche Mischung enthält, bzw. auf die Verwendung der beiden Verbindungen zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von reispathogenen Schadpilzen.

Keine der genannten Entgegenhaltungen offenbart die spezifischen Mischungen, die Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind..

D1 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, unter die

auch TP1 fällt, mit anderen Fungiziden, unter ihnen auch Fluazinam. Die bevorzugten und in Beispielen benutzten Azolopyrimidine A, B und C (im Folgenden TPa, TPb bzw. TPc genannt) sind das 6-(2-Cl-6-F-Phenyl)-, das 7-(2,2,2Trifluorethylamino)- bzw. das 7-(1,1,1-Trifluoropropyl-2-yl-amino)-Analoge des TP1. TPa und TPc sind die Vergleichsverbindungen A bzw. B der vorliegenden Anmeldung. Im Beispiel (D1, Beispiel 14) wird TPc zusammen mit Fluazinam verwendet.

D2 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) u.a. spezifisch die Verbindung TP1 (Beispielverbindung 2). Die Verbindung wird hinsichtlich ihrer Wirkung gegen echten Mehltau auf Weintrauben mit TPa verglichen und überlegen gefunden. Die Möglichkeit der Mischung mit anderen Fungiziden, unter denen auch Fluazinam aufgeführt wird, unter Umständen unter Erzielung eines synergistischen Effektes, wird erwähnt aber nicht realisiert.

D3 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) bestimmte N-Pyridylaniline, darunter Fluazinam (Verbindung 7) unter anderem als Fungizide.

D4 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) bestimmte fungizide Triazolopyrimidine, darunter TPa. Die Wirkung gegen *Pyricularia oryzae* auf Reis wird demonstriert (siehe D4, Beispiele 225 und 226).

D5 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von unter anderem aus D4 bekannten Triazolopyrimidinen mit Melaninbiosynthesehemmern wie Carpropamid, Pyroquilon und Fenoxanil. Diese Mischungen sind insbesondere wirksam gegen Reispathogene (*Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus*, der die Braunfleckenkrankheit verursacht). Die bevorzugten in D5 als Azolopyrimidine A, C und D bezeichneten Verbindungen sind die oben erwähnten TPa, TPb bzw. TPc.

D6 untersucht (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) die Struktur-Aktivität-Beziehung von N-Pyridylanilinen, wie Fluazinam, hinsichtlich ihrer Wirkung auf die Pathogene *Pyricularia oryzae* und *Rhizoctonia solani* auf Reis sowie *Sphaerotheca fuliginea* auf Gurken, und legt Entkopplung der mitochondrialen Atmung als

hauptsächlichen Wirkmechanismus gegen diese Pathogene nahe.

D7 schließlich offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von fungiziden Acrylmorpholiden, vorzugweise Dimethomorph, mit N-Pyridylanilinen, vorzugsweise Fluazinam, insbesondere zur Bekämpfung von Oomyceten.

Erfinderische Tätigkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 beruht nicht auf einer erforderlichen Tätigkeit (Artikel 33(1) und (3) PCT).

Im Lichte der Beschreibung und des nächsten Standes der Technik der Entgegenhaltung D1 kann als die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung synergistischer Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden angesehen werden, die sich zur Bekämpfung von Reispathogenen eignen, das heißt, die eine hohe Systemik mit einer guten Wirksamkeit gegen Pathogene wie *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus* vereinen.

Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins TP1 in Kombination mit dem Fluazinam gekennzeichnet.

In Anbetracht des oben dargelegten Standes der Technik ist diese Kombination eine naheliegende Lösung der Aufgabe.

In D1 werden bereits Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, die sowohl TPa, TPb und TPc als auch TP1 umfasst, mit Fluazinam vorgeschlagen. Spezifisch offenbart wird dort die Mischung mit dem Triazolopyrimidin TPc. Die Entgegenhaltung erwähnt nicht ausdrücklich die Verwendung zur Bekämpfung von Reispathogenen.

Die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel sind aber aus der Entgegenhaltung D4 als wirksam gegen Reispathogene bekannt, so wird dort z.B. die Wirksamkeit des in der vorliegenden Anmeldung als Vergleichssubstanz herangezogenen TPa (Verbindung 139, in D4) gegen *Pyricularia oryzae* beispielhaft demonstriert (siehe Beispiel 226).

Aus D5 (siehe oben) sind synergistische Mischungen solcher Triazolopyrimidine darunter wiederum TPa und das andere in der vorliegenden Anmeldung als Vergleichssubstanz

herangezogene TPc mit anderen Fungiziden bekannt. Diese Mischungen sind insbesondere gegen Reispathogene wie *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus* wirksam.

Andererseits ist auch bekannt, z.B. aus den Entgegenhaltungen D3 und D6, dass Fluazinam ebenfalls gute Wirksamkeit gegen Reispathogene zeigt.

So demonstriert D3 die Wirksamkeit von Fluazinam gegen die Reispathogene *Pyricularia oryzae* und *Rhizoctonia solani*, wobei es sich z.B. einem bereits bekannten Pyridylaniline überlegen erweist (siehe D3, Tabelle 2).

D6 zeigt, dass Fluazinam gegen *Pyricularia oryzae* und *Rhizoctonia solani* auf Reis hochaktiv bzw. aktiv ist (siehe D6, Tabellen 1 und 2).

Der Fachmann konnte deshalb erwarten, dass das aus D1 bekannte Gemisch aus TPc und Fluazinam, dessen Wirksamkeit dort beispielhaft (Beispiel 14) nur gegen *Puccinia recondita* auf Weizen gezeigt wird, auch gut zur Bekämpfung von Reispathogenen geeignet ist, also eine Lösung der oben definierten Aufgabe ist.

Nun wird aber außerdem in D2 ausdrücklich betont, dass die dort offenbarten 6-(2,4,6-Trifluoropenyl)-triazolopyrimidine (wie z.B. TP1) gegenüber den aus D4 bekannten Triazolopyrimidinen (wie z.B. TPa und TPc) erhöhte Systemik und fungitoxische Wirkung gegen Reispathogene haben (siehe D2, Seite 7, Zeilen 9-11). Die gute Wirksamkeit speziell des TP1 gegen *Pyricularia oryzae* (= *Pyricularia grisea* f. sp. *oryzae*, Teleomorph: *Magnaporthe gr. f. sp. oryzae*) und *Rhizoctonia solani* wird ihm Beispielen gezeigt (siehe D2, Tabelle II).

Es war daher naheliegend die Wirksamkeit der in D1 vorgeschlagenen Gemische aus Fluazinam und einem Triazolopyrimidine entsprechend der dort gegebenen Formel (I) speziell gegen Reispathogene dadurch zu optimieren, dass man statt des im Beispiel 14 für einen Test gegen *Puccinia recondita* auf Weizen verwendeten TPc das für diesen Zweck überlegene aus D2 bekannte TP1 wählt.

Dieser Umstand ändert sich auch nicht dadurch, dass sich rückblickend gezeigt hat, dass die Angabe des Standes der Technik D2 bezüglich der Überlegenheit der dort offenbarten spezifischen Triazolopyrimidine, wie z.B. der zweiten Beispielsverbindung (=TP1)

gegenüber den aus D4 bekannten und in D1 verwendeten, wie z.B. TPa und TPc, zur Bekämpfung speziell von Reiskrankheiten inkorrekt war, zumindest soweit es die Wirksamkeit von TP1 im Vergleich mit TPa und TPc gegenüber einem ganz bestimmten Reispathogen (*Cochliobolus miyabeanus*) betrifft.

Erst recht kann dies nicht zur Schlussfolgerung führen D2 führe den Fachmann sogar von der Erfindung weg.

D2 schreibt unmissverständlich (siehe D2, Seite 2, Zeilen 12-16 bzw. Seite 7, Zeilen 9-11): [bezugnehmend auf D4] "These compounds are said to be active against fungi which are members of the ascomycetes class such as *Venturia inaequalis* and of the hypomycetes such as *Alternaria solani* and *Botrytis cinerea*. However, there is no single compound in which R³ is a 2,4,6-trifluorophenyl group." [letzteres ist ein kennzeichnendes Merkmal für die Verbindungen nach D2] und [bezugnehmend auf die Verbindungen gemäß D2] "They are superior through their valuable fungicidal properties, in particular their enhanced systemicity and **enhanced fungicotoxicity [sic] against rice diseases and powdery mildew.**" [Hervorhebung zugefügt].

Der Stand der Technik führt deshalb den Fachmann zur Erfindung hin. Der Fachmann hatte und hat keine Veranlassung an der grundsätzlichen Richtigkeit der Aussage von D2 zu zweifeln, und dies auch noch ausgerechnet gegenüber einer Verbindung (Beispielverbindung 2 = TP1) für die in D2 in biologischen Tests gezeigt wird, dass sie gegen ein wichtiges Reispathogen sogar (zusammen mit einigen anderen) die wirksamste der in D2 offenbarten Verbindungen ist (siehe Tabelle II, Spalte "PYRIOR").

Die in abhängigen Ansprüchen angeführten zusätzlichen Merkmale, wie z.B. die Mengenverhältnisse und Aufwandmengen sind im Rahmen des Üblichen, und können deshalb keinen erfinderischen Beitrag bestimmen.

Industrielle Anwendbarkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 wird als industriell anwendbar erachtet (Artikel 33(1) and (4) PCT).